

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平5-229927

(43) 公開日 平成5年(1993)9月7日

(51) Int.Cl. ⁵	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K 7/48		9051-4C		
7/00	X	9165-4C		
	C	9165-4C		
	H	9165-4C		

審査請求 未請求 請求項の数 1 (全 6 頁)

(21) 出願番号 特願平4-35084

(22) 出願日 平成4年(1992)2月21日

(71) 出願人 000000918

花王株式会社

東京都中央区日本橋茅場町1丁目14番10号

(72) 発明者 加藤 直樹

千葉県千葉市朝日ヶ丘町1-3

(72) 発明者 鈴木 裕二

千葉県佐倉市中志津3-28-1-102

(74) 代理人 弁理士 有賀 三幸 (外2名)

(54) 【発明の名称】 美白化粧品

(57) 【要約】

【構成】 下記成分 (A) 及び (B)

(A) L-アスコルビン酸及び水溶性L-アスコルビン酸誘導体からなる群より選ばれる1種又は2種以上

(B) 尿素

を含有する美白化粧品。

【効果】 水溶性L-アスコルビン酸誘導体の皮膚浸透性が顕著で、優れた美白効果とシミ、ソバカス等の予防・治療効果とを有する。

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記成分 (A) 及び (B)

(A) L-アスコルビン酸及び水溶性L-アスコルビン酸誘導体からなる群より選ばれる1種又は2種以上

(B) 尿素

を含有することを特徴とする美白化粧品。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】 本発明は美白化粧品に関し、更に詳しくは皮膚淡色効果、及び日焼けによるシミ、ソバカス改善効果を有する美白化粧品に関するものである。

【0002】

【従来の技術及び発明が解決しようとする課題】 従来、L-アスコルビン酸及びその誘導体に美白効果があることが知られており、美白化粧品の有効成分として広く使用されてきている。しかしながら、一般にL-アスコルビン酸及び水溶性L-アスコルビン酸誘導体の皮膚への浸透性は低く、そのために美白効果が十分に発揮されないという問題が生じてきている。このような有効成分の皮膚浸透性を向上させる浸透促進剤の研究もなされているが、これまでのところ、浸透促進効果を有するものは皮膚安全性の面で劣り、化粧品への応用には依然問題がある。

【0003】

【課題を解決するための手段】 本発明者らは、かかる実情に鑑み鋭意検討した結果、L-アスコルビン酸類と尿素とを併用することにより、皮膚浸透性に優れ、美白効果が良好で、かつ安全性の高い美白化粧品の得られることを見出し、本発明を完成するに至った。

【0004】 すなわち、本発明は、下記成分 (A) 及び (B)

(A) L-アスコルビン酸及び水溶性L-アスコルビン酸誘導体からなる群より選ばれる1種又は2種以上

(B) 尿素

を含有することを特徴とする美白化粧料を提供するものである。

【0005】 本発明に用いられる成分 (A) の水溶性L-アスコルビン酸誘導体は特に限定されないが、具体例としてL-アスコルビン酸リン酸エステル、1価金属塩であるL-アスコルビン酸リン酸エステルナトリウム塩、L-アスコルビン酸リン酸エステルカリウム塩、2価金属塩であるL-アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩、L-アスコルビン酸リン酸エステルカルシウム塩、3価金属塩であるL-アスコルビン酸リン酸エステルアルミニウム塩、またL-アスコルビン酸硫酸エステルの1価金属塩であるL-アスコルビン酸硫酸エステルナトリウム塩、L-アスコルビン酸硫酸エステルカリウム塩、2価金属塩であるL-アスコルビン酸硫酸エステルマグネシウム塩、L-アスコルビン酸硫酸エステルカルシウム塩、3価金属塩であるL-アスコルビン酸

2

硫酸エステルアルミニウム塩、そしてL-アスコルビン酸の1価金属塩であるL-アスコルビン酸ナトリウム塩、L-アスコルビン酸カリウム塩、2価金属塩であるL-アスコルビン酸マグネシウム塩、L-アスコルビン酸カルシウム塩、3価金属塩であるL-アスコルビン酸アルミニウム塩等が挙げられる。これらは単独でも、また2種以上を混合して使用してもよい。

【0006】 本発明美白化粧料中の成分 (A) の含有量は通常0.1～10重量% (以下%という)、好ましくは1～5%である。

【0007】 本発明美白化粧料中の成分 (B) の尿素有量は通常0.05～10%、好ましくは0.2～5%である。0.05%未満では十分な効果は得られず、10%以上配合してもそれに見合う効果は得られない。

【0008】 また、必要に応じて、尿素の安定化剤を配合することができる。尿素の安定化剤としては、乳酸、アミノ酸及びその塩、ニコチン酸及びその誘導体、無機アンモニウム塩、アミノカルボン酸、ジカルボン酸、コラーゲン、エラスチン等が挙げられる。

【0009】 本発明美白化粧料は、本発明の効果を損なわない範囲で、通常化粧料、医薬部外品、医薬品等に用いられる乳化剤、油剤、紫外線吸収剤、保湿剤、増粘剤、顔料、粉体、薬効成分、抗酸化剤、防腐剤、香料等を適宜配合し、常法に従って製造することができる。

【0010】 以下に具体例を示す。油剤としては流動パラフィン、ワセリン、パラフィンワックス、スクワラン、ミツロウ、カルナウバロウ、オリーブ油、ラノリン、高級アルコール、脂肪酸、高級アルコールと脂肪酸の合成エステル油、シリコーン油等が挙げられ、保湿剤としてはソルビトール、キシリトール、グリセリン、マルチトール、プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール、1,4-ブチレングリコール、ピロリドンカルボン酸ナトリウム、乳酸、乳酸ナトリウム、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステル、ポリエチレングリコール等が挙げられ、増粘剤としてはカルボキシビニルポリマー、カルボキシメチルセルロース、ポリビニルアルコール、カラギーナン、ゼラチン等の水溶性高分子、塩化ナトリウム、塩化カリウム等の電解質などが挙げられ、防腐剤としては尿素、メチルパラベン、エチルパラベン、プロピルパラベン、ブチルパラベン、安息香酸ナトリウム等が挙げられ、乳化剤としてはポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、ポリグリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシエチレンソルビトール脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤が挙げられ、粉体としてはタルク、セリサイト、マイカ、カオリン、シリカ、ベントナイト、パーミキュライト、亜鉛華、雲母、雲母チタン、酸化チタン、酸化マグネシウ

ム、酸化ジルコニウム、硫酸バリウム、ベンガラ、酸化鉄、群青等が挙げられ、pH調整剤としては乳酸-乳酸ナトリウム、クエン酸-クエン酸ナトリウム等の緩衝剤が挙げられ、薬効成分としてはアルブチン、コウジ酸や、カッコン抽出物、リョクチャ抽出物、チョウジ抽出物等の植物抽出物等が挙げられる。

【0011】また、本発明の対象となる化粧品は、一般の皮膚化粧品に限定されるものではなく、医薬部外品、外用医薬品等を含有しうるものであり、その剤型もクリーム、乳液、化粧水、ファンデーション、パック、ローション状、ゲル状、溶液状、スティック状等、その目的に応じて任意に選択することができる。

【0012】

【発明の効果】本発明美白化粧品は、L-アスコルビン酸又は水溶性L-アスコルビン酸誘導体と尿素とを併用することにより、L-アスコルビン酸又は水溶性L-アスコルビン酸誘導体の皮膚浸透性が高められ、優れた美白効果と、日焼け等によるシミ及びソバカスの予防及び治療効果とを有するものである。

【0013】

【実施例】以下に本発明を実施例により具体的に説明するが、本発明はこれらによって限定されるものではない。なお、以下の実施例において、皮膚浸透性評価及び美白効果評価は下記の方法により行った。

【0014】皮膚浸透性評価

豚皮背部を除毛し、表面を洗浄した後、4cm四方の小片に裁断する。以下に示す実施例及び比較例の試料40 μ lを調製して豚皮に塗布し、室温に放置する。表面に残存する未浸透成分を除去した後、浸透成分を抽出回収し、HPLCにてL-アスコルビン酸又は水溶性L-アスコルビン酸誘導体の皮膚への浸透量を測定した。皮膚浸透量は塗布面積当たりの値(μ g/cm²)で表わした。

【0015】UV-B誘導色素斑に対する美白効果試験

健康男子被験者20名の上腕内側部に、UV-B領域の紫外線を最少紅斑量の2倍量、1日1回2日間にわたり照射し、誘導した色素斑に1日2回、1カ月間被験部位に試料を連続塗布することによる美白効果を調べた。評価は、色差計(村上色彩製、CMS-1200)を用いて測定を行い、得られたマンセル値よりL*値を算出し、その回復を表わす $\Delta\Delta L^*$ 値を用いた。尚、 $\Delta\Delta L^*$ 値は以下のように定義した。試料塗布開始直前の試料塗布被験部位及び試料未塗布被験部位のL*値をそれぞれL₀、L₀'、連続塗布1カ月後の各々の部位のL*値をそれぞれL₁、L₁'として $\Delta\Delta L^*$ を以下の式で表わした。

$$\Delta\Delta L^* = (L_1 - L_0) - (L_1' - L_0')$$

また、評価は被験者20名の評価点の平均値で示した。評価点と判定基準との関係を表1に示す。

【0016】

【表1】

評価点	判定基準
5	$1.0 \leq \Delta\Delta L^*$
4	$0.5 \leq \Delta\Delta L^* < 1.0$
3	$0.2 \leq \Delta\Delta L^* < 0.5$
2	$0 \leq \Delta\Delta L^* < 0.2$
1	$\Delta\Delta L^* < 0$

【0017】実施例1~2及び比較例1

表2にその組成を示す美白化粧品を常法に従い調製した。各被験品中の水溶性L-アスコルビン酸誘導体の皮膚浸透量を表2に併せて示す。

【0018】

【表2】

(重量%)

組成 \ 被験品	実施例 1	実施例 2	比較例 1
Ｌ－アスコルビン酸リン酸 エステルマグネシウム	3.0	3.0	3.0
尿素	1.0	3.0	—
6－アミノ－n－カプロン酸	0.5	0.5	0.5
クエン酸ナトリウム	1.0	1.0	1.0
エデト酸二ナトリウム	0.1	0.1	0.1
精製水	残部	残部	残部
皮膚浸透量 ($\mu\text{g}/\text{cm}^2$)	2.48	2.66	0.84

【0019】表2より明らかなように、本発明品中の水溶性Ｌ－アスコルビン酸誘導体の皮膚浸透量が著しく大であることがわかる。

【0020】実施例3～4及び比較例2

表3にその組成を示す美白クリームを下記の方法により*

*調製し、水溶性Ｌ－アスコルビン酸誘導体の皮膚浸透性評価及び連続塗布による美白効果について評価を行った。表3に併せて結果を示す。

【0021】

【表3】

(重量%)

組成 \ 被験品	実施例 3	実施例 4	比較例 2
(1) モノステアリン酸グリセリン	5.0	5.0	5.0
(2) モノステアリン酸 ポリエチレングリコール	2.0	2.0	2.0
(3) スクワラン	8.0	8.0	8.0
(4) ステアリルアルコール	5.0	5.0	5.0
(5) トリオクタン酸グリセリル	8.0	8.0	8.0
(6) ジメチルポリシロキサン (50cs)	0.5	0.5	0.5
(7) パラオキシ安息香酸ブチル	0.1	0.1	0.1
(8) グリセリン	5.0	5.0	5.0
(9) エデト酸二ナトリウム	0.1	0.1	0.1
(10) クエン酸ナトリウム	1.0	1.0	1.0
(11) パラオキシ安息香酸メチル	0.1	0.1	0.1
(12) Ｌ－アスコルビン酸リン酸 エステルマグネシウム	3.0	3.0	3.0
(13) 尿素	1.0	3.0	—
(14) ニコチン酸アミド	0.5	0.5	0.5
(15) 精製水	残部	残部	残部
皮膚浸透量 ($\mu\text{g}/\text{cm}^2$)	3.05	3.23	0.98
評価点	3.85	4.00	1.95

【0022】(調製方法) 油相成分(1)～(7)を80℃で加熱溶解したものに、攪拌しながら80℃に加熱した水相成分(8)～(15)を加えて乳化する。

【0023】表3より明らかなように、本発明品は水溶性Ｌ－アスコルビン酸誘導体の皮膚浸透量が有意に高組成

く、美白効果も優れたものであった。

【0024】実施例5

以下にその組成を示す乳液を下記方法により調製した。

【0025】

(重量%)

(1) トリステアリン酸ポリオキシエチレンソルビタン

1.0

7	8
(2) オレイン酸グリセリン	1.0
(3) モノステアリン酸グリセリン	0.5
(4) スクワラン	5.0
(5) トリオクタン酸グリセリル	2.0
(6) ジメチルポリシロキサン (50cs)	0.2
(7) オクタン酸セチル	1.5
(8) ステアリルアルコール	2.0
(9) メトキシケイ皮酸オクチル	2.0
(10) パラオキシ安息香酸ブチル	0.1
(11) 1, 3-ブチレングリコール	5.0
(12) グリセリン	3.0
(13) キサンタンガム	0.2
(14) エデト酸四ナトリウム	0.1
(15) クエン酸ナトリウム	1.0
(16) L-アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム	3.0
(17) 尿素	2.0
(18) グリシン	0.5
(19) パラオキシ安息香酸メチル	0.1
(20) イオン交換水	残部

【0026】(調製方法) 油相成分(1)～(10)を 20* 【0027】実施例6

80℃で加熱溶解したものに、攪拌しながら80℃に加熱した水相成分(11)～(20)を加えて乳化し、次いで、攪拌しながら室温まで冷却する。

以下にその組成を示す化粧水を下記方法により調製した。

* 【0028】

組成

	(重量%)
(1) 1, 3-ブチレングリコール	8.0
(2) グリセリン	4.0
(3) キサンタンガム	0.1
(4) コンドロイチン硫酸ナトリウム	0.1
(5) ヒアルロン酸ナトリウム	0.1
(6) エタノール	3.0
(7) パラオキシ安息香酸メチル	0.1
(8) ポリオキシエチレン-オレイルエーテル (20E.O.)	0.5
(9) エデト酸四ナトリウム	0.1
(10) クエン酸ナトリウム	1.0
(11) L-アスコルビン酸	4.0
(12) 尿素	1.0
(13) 6-アミノ-n-カプロン酸	0.5
(14) イオン交換水	残部

【0029】(調製方法) (1)～(5)の成分を攪拌 40 解する。

分散した後、イオン交換水(14)65部を加えAとする。(6)～(8)を攪拌溶解した後、残量のイオン交換水(14)を加えBとする。Aを攪拌しながらBを加え均一にした後、(9)～(13)の成分を加え攪拌溶

組成

	(重量%)
(1) メチルポリシロキサン (6cs)	10.0
(2) メチルフェニルポリシロキサン	3.0
(3) オクタメチルシクロテトラシロキサン	10.0
(4) ポリオキシアルキレン変性シリコーン	5.0

【0030】実施例7

以下にその組成を示すクリーム状ファンデーションを下記方法により調製した。

【0031】

9	10
(5) 酸化チタン	5.0
(6) セリサイト	2.0
(7) タルク	3.0
(8) ベンガラ	0.4
(9) 酸化鉄黄	0.7
(10) 酸化鉄黒	0.1
(11) プチルバラベン	0.1
(12) グリセリン	5.0
(13) エデト酸二ナトリウム	0.1
(14) L-アスコルビン酸硫酸エステルナトリウム	2.0
(15) クエン酸ナトリウム	1.0
(16) 尿素	0.5
(17) 6-アミノ-n-カプロン酸	0.5
(18) メチルバラベン	0.1
(19) イオン交換水	残量

【0032】（調製方法）（1）～（11）の成分を80℃で加熱溶解し攪拌しながら、（12）～（19）の成分を80℃に加熱溶解した水相を加え均一に乳化する。

* 【0033】実施例8

以下にその組成を示すバックを下記方法により調製した。

* 【0034】

組成

	(重量%)
(1) ジブロピレングリコール	3.0
(2) ポリエチレングリコール	3.0
(3) 1, 3-ブチレングリコール	1.0
(4) グリセリン	2.0
(5) ピロリドンカルボン酸ナトリウム	1.0
(6) クエン酸ナトリウム	1.0
(7) エデト酸二ナトリウム	0.1
(8) 尿素	2.0
(9) 乳酸	0.5
(10) ポリビニルアルコール	12.0
(11) L-アスコルビン酸ナトリウム	2.0
(12) エタノール	5.0
(13) パラオキシ安息香酸メチル	0.1
(14) ポリオキシエチレンポリオキシプロピレン デシルテトラデシルエーテル	0.3
(15) 精製水	残部

【0035】（調製方法）（1）～（9）の成分をイオン交換水（15）50部と攪拌して溶解しAとする。

（12）～（14）の成分を攪拌溶解した後、残量のイオン交換水（15）を加えて均一にしBとする。Aを攪拌しながら（10）及び（11）を加え、均一に分散した後、70℃に加熱溶解する。これを45℃に冷却し、Bを加えて均一にし、室温まで冷却する。

【0036】上記実施例5～8のそれぞれにおいて、尿

素を除いた以外は同様のものを調製し、L-アスコルビン酸又は水溶性L-アスコルビン酸誘導体の皮膚浸透性及び美白効果を比較したところ、いずれの実施例においても尿素有含有するものが優れた値を示した。また、いずれの実施例においても、L-アスコルビン酸又は水溶性L-アスコルビン酸誘導体を除いたものは美白効果を示さなかった。

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record.**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.